

Document made available under the Patent Cooperation Treaty (PCT)

International application number: PCT/JP04/018206

International filing date: 07 December 2004 (07.12.2004)

Document type: Certified copy of priority document

Document details: Country/Office: JP
Number: 2003-436434
Filing date: 09 December 2003 (09.12.2003)

Date of receipt at the International Bureau: 04 February 2005 (04.02.2005)

Remark: Priority document submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b)



World Intellectual Property Organization (WIPO) - Geneva, Switzerland
Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle (OMPI) - Genève, Suisse

日 本 国 特 許 庁 09.12.2004
JAPAN PATENT OFFICE

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出 願 年 月 日 2 0 0 3 年 1 2 月 9 日
Date of Application:

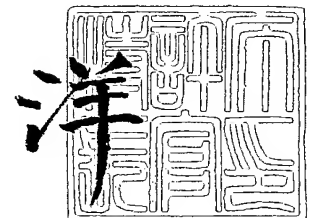
出 願 番 号 特 願 2 0 0 3 - 4 3 6 4 3 4
Application Number:
[ST. 10/C]: [J P 2 0 0 3 - 4 3 6 4 3 4]

出 願 人 サンスター株式会社
Applicant(s):

2 0 0 5 年 1 月 2 1 日

特許庁長官
Commissioner,
Japan Patent Office

小 川



【書類名】 特許願
【整理番号】 15JP0016
【提出日】 平成15年12月 9日
【あて先】 特許庁長官殿
【国際特許分類】 A61K 7/16
【発明者】
 【住所又は居所】 大阪府高槻市上土室 5 - 3 0 - 1 サンスター土室事業所内
 【氏名】 安田 直美
【発明者】
 【住所又は居所】 大阪府高槻市上土室 5 - 3 0 - 1 サンスター土室事業所内
 【氏名】 井上 篤史
【特許出願人】
 【識別番号】 000106324
 【氏名又は名称】 サンスター株式会社
 【代表者】 金田 博夫
【手数料の表示】
 【予納台帳番号】 026653
 【納付金額】 21,000円
【提出物件の目録】
 【物件名】 特許請求の範囲 1
 【物件名】 明細書 1
 【物件名】 要約書 1

【書類名】 特許請求の範囲**【請求項 1】**

レオロジー測定器で測定した組成物中のカプセルの崩壊強度が 0. 0 5 N 以下であることを特徴とするカプセル配合口腔用組成物。

【請求項 2】

カプセル皮膜成分が、アルギン酸塩、キサンタンガム、寒天、カラギーナン、ジェランガム、グルコマンナン、ローカストベングラムから選ばれる 1 種又は 2 種以上で、油性成分を内包したカプセルを配合することを特徴とする請求項 1 項に記載のカプセル配合口腔用組成物。

【請求項 3】

カプセルの粒径が 0. 3 ～ 3. 0 mm であることを特徴とする請求項 1、2 項の何れか 1 項に記載のカプセル配合口腔用組成物。

【書類名】明細書

【発明の名称】カプセル配合口腔用組成物

【技術分野】

【0 0 0 1】

本発明は、油性成分を内包するカプセルを含有してなるカプセル配合口腔用組成物に関する。さらに詳しくは該組成物の使用時にカプセルが崩壊し、速やかに内包物が放出、分散されるため、内包成分が効果的に口腔内で作用するカプセル配合口腔用組成物に関する。

【背景技術】

【0 0 0 2】

従来から口腔用組成物にカプセルを配合する技術は多数開示されており、例えば特開平 0 1 - 3 8 0 1 6 号公報、特開平 0 4 - 3 6 8 3 1 9 号公報、特開 2 0 0 3 - 6 3 9 3 9 号公報は粒の崩壊する力を利用し歯垢除去を目的としている。特開昭 4 9 - 4 5 3 号公報、特公昭 6 3 - 4 8 5 8 0 号公報、特公平 5 - 5 8 4 0 4 号公報、特公昭 5 0 - 2 5 0 1 1 号公報、特開昭 6 1 - 2 2 5 1 1 5 号公報に開示されているカプセルは崩壊することが前提となっているが、これらの粒は製造時における破損を防止する目的で粒の膜厚を厚くするなどの強度向上手段が取られている。

【0 0 0 3】

一方、特開平 0 8 - 1 6 9 8 1 3 号公報、特開平 1 0 - 6 7 6 2 5 号公報、特開 2 0 0 0 - 3 0 2 6 5 4 号公報に開示されている発明では速やかにカプセル粒が崩壊するものの、カプセルの皮膜が口の中に残るものである。特開 2 0 0 0 - 3 1 9 1 5 1 号公報に開示されている平均粒径が $1 \sim 50 \mu\text{m}$ の小さなカプセル粒はつぶれにくく、特開 2 0 0 2 - 2 0 2 5 2 号公報にある平均粒径が 3 mm 以上の大きいカプセル粒は口腔用組成物に用いられる通常の用法でそれをつぶすことは難しい。いずれにせよ、カプセル配合口腔用組成物にあって、それを適用している間にカプセル粒がつぶれ、その皮膜残渣が残らないようなカプセルについての開示はない。

【0 0 0 4】

【特許文献 1】特開平 0 1 - 3 8 0 1 6 号公報

【特許文献 2】特開平 0 4 - 3 6 8 3 1 9 号公報

【特許文献 3】特開 2 0 0 3 - 6 3 9 3 9 号公報

【特許文献 4】特開昭 4 9 - 4 5 3 号公報

【特許文献 5】特公昭 6 3 - 4 8 5 8 0 号公報

【特許文献 6】特公平 5 - 5 8 4 0 4 号公報

【特許文献 7】特公昭 5 0 - 2 5 0 1 1 号公報

【特許文献 8】特開昭 6 1 - 2 2 5 1 1 5 号公報

【特許文献 9】特開平 0 8 - 1 6 9 8 1 3 号公報

【特許文献 1 0】特開平 1 0 - 6 7 6 2 5 号公報

【特許文献 1 1】特開 2 0 0 0 - 3 0 2 6 5 4 号公報

【特許文献 1 2】特開 2 0 0 0 - 3 1 9 1 5 1 号公報

【特許文献 1 3】特開 2 0 0 2 - 2 0 2 5 2 号公報

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0 0 0 5】

本発明の目的は、口腔用組成物の使用時に容易にカプセル粒が崩壊し、速やかに内包物が放出・分散されるとともに、すすぎ時に口の中にカプセル成分が違和感として残らない口腔用組成物を提供することである。

【課題を解決するための手段】

【0 0 0 6】

本発明者らは、上記目的を達成するため鋭意検討を重ねた結果、組成物中で崩壊強度が 0. 0 5 N 以下に低下するカプセルを配合することで目的が達せられることを見出し本発

明の完成に至った。

【発明の効果】

【0007】

すなわち、本発明では、口腔用組成物の使用時に容易にカプセル粒が崩壊し、速やかに内包された油性成分が放出・分散され、且つすすぎ時に口中にカプセル成分が異物として残らないことから、清掃性に優れ、使用感、清涼感の良好な口腔用組成物の提供が期待できる。

【発明を実施するための最良の形態】

【0008】

以下に、本発明を詳細に説明する。本発明に用いるカプセルは口腔用組成物中での崩壊強度が0.05N以下であり、そのためのカプセル成分としては、アルギン酸塩、キサンタンガム、寒天、カラギーナン、ジェランガム、グルコマンナン、ローカストビンガムから選ばれる1種または2種以上であり、好ましくはアルギン酸塩、ジェランガム、カラギーナン、寒天、ローカストビンガムであり、特に好ましくはアルギン酸塩、カラギーナン、寒天である。カプセル崩壊強度はレオロジー測定装置を用いて測定する。

【0009】

本発明に用いるカプセルの平均粒径は0.3~3.0mmが好ましく、さらに0.5~2.5mmが最も好ましい。カプセルの平均粒径が0.3mm未満ではカプセルが潰れにくく、それが3mmを超えると潰れにくいだけでなく、口中での違和感が強い。本発明に用いるカプセルは油性成分を内包する。内包する油性成分は、特に限定されるものではなく、例えば、香料、ビタミンEなどの油溶性ビタミン類、トリクロサン、チモールなどの油溶性薬効剤、油溶性植物抽出物、保湿用オリーブ油、シリコン油などの機能性オイル、油溶性色素などから、目的により適宜選択される。

【0010】

油性成分を内包したカプセルは、例えば、架橋剤を含む溶液に滴下し粒化する方法（液中滴下法）で製造される。これらカプセルの口腔用組成物への配合量は組成物全量に対して0.5~5.0重量%、より好ましくは1.0~3.0重量%である。配合量が0.5重量%に満たないと1回のブラッシング時に粒が出てこないことが発生し、粒の効果が実感できない。また、5.0重量%を超えると見た目が良くない。

本発明のカプセル配合口腔用組成物は通常の口腔用組成物と同様の製造方法で製することができ、言うまでもなく該組成物の製造時に、カプセルが崩壊しないように製造する。

【0011】

本発明のカプセル配合口腔用組成物にあつては、アニオン界面活性剤およびノニオン界面活性剤から選ばれる1種以上が配合できる。本発明で用いるアニオン界面活性剤は、特に限定されるものでなく、例えばラウリル硫酸ナトリウム、ミリスチル硫酸ナトリウム、N-ラウロイルザルコシネート、ラウロイルメチルタウリン、ラウリルスルホコハク酸塩などを挙げることができ、特にラウリル硫酸ナトリウムが好ましい。

【0012】

又、ノニオン界面活性剤は、特に限定されるものでなく、例えばショ糖脂肪酸エステル、ミリスチン酸ジエタノールアミド、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレングリコール、アルキルグルコシド、ポリグリセリン脂肪酸エステル等を挙げることができ、特にポリオキシエチレン硬化ヒマシ油が好ましい。これらアニオン界面活性剤及びノニオン界面活性剤の配合量は、組成物全量に対して、アニオン界面活性剤では0.1~3.0重量%、好ましくは1.0~2.5重量%、ノニオン界面活性剤では0.1~3.0重量%、好ましくは0.5~2.0重量%である。

【0013】

本発明のカプセル配合口腔用組成物のpHは5.5~8.0、好ましくは6.0~7.0である。pHが5.5以下では歯牙が溶出することが懸念され、pHが8.0以上であるとカプセルの安定性に不都合が生じる。

【0014】

本発明のカプセル配合口腔用組成物は、練歯磨、液状歯磨、水歯磨、洗口剤などの形態で供することができ、中でも練歯磨、液状歯磨、洗口剤が好ましい。

【0015】

本発明のカプセル配合口腔用組成物では、夫々の形態に応じて、通常の口腔用組成物に用いる成分を適宜配合することができる。具体的には、研磨剤としては、沈降性シリカ、ジルコノシリケート、アルミノシリケート、リン酸カルシウム、炭酸カルシウム、水酸化アルミニウム、酸化アルミニウム等（通常配合量1～40重量%）
湿潤剤としてエタノール、グリセリン、ソルビット、エチレングリコール、プロピレングリコール、1,3-ブチレングリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、キシリトール、マルチトール、ラクチトール等（通常配合量2～70%）

分散剤としてアルギン酸ナトリウム、カラギーナン、カルボキシメチルセルロースナトリウム、メチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロースなどのセルロース誘導体、トラガントガム、カラヤガム、アラビアガム、キサンタンガム、ジェランガムなどのガム類、ポリアクリル酸ナトリウム、ポリビニルアルコール、カルボキシビニルポリマー、ポリビニルピロリドン等の合成水溶性高分子及びシリカゲル、アルミニウムシリカゲル、ビーガム、ラボナイトなどの無機分散剤（通常配合量0.005～1%）

【0016】

界面活性剤としては上述のアニオン性界面活性剤、非イオン界面活性剤等の他にN-アールキルジアミノエチルグリシンやベタイン型界面活性剤などの両性界面活性剤も使用できる。有効成分としてはフッ化ナトリウム、モノフルオロリン酸ナトリウム、フッ化第一錫等のフッ素化合物、デキストラナーゼ、ムタナーゼ、プロテアーゼ、リゾチーム等の酵素、トラネキサム酸、ε-アミノカプロン酸、アルミニウムクロルヒドロキシアラントイン、ジヒドロコレスタノール、グリチルリチン酸類、ビスボロール、イソプロピルメチルフェノール、グリセロフォスフェート、クロロフィル、グルコン酸銅、塩化ナトリウム、水溶性無機リン酸化合物、クロルヘキシジン塩類、トリクロサン、塩化セチルピリジニウム、塩化ベンザルコニウム、塩化ベンゼトニウム、チョウジ、ローズマリー、タイム、オウゴン等の植物抽出物等、香味剤としてサッカリンナトリウム、ステビオサイド、グリチルリチン、アスパラチルフェニルアラニンメチルエステル、メントール、アネトール、カルボン、オイゲノール、リモネン、ペパーミント、スペアミント、ウインターグリーン等、着色剤などが例示される。

【実施例】

【0017】

次に、実施例および試験例を挙げて、本発明をさらに詳しく説明する。いうまでもなく、本発明はこれら実施例に限るものでなく、また特に断らない限り[%]は[重量%]を示す。

【0018】

本発明のカプセルの崩壊強度はレオロジー測定装置を用いて測定するもので、カプセルに荷重をかけていき、崩壊強度を測定した。本発明のカプセル崩壊強度とは、カプセルが崩壊した時の荷重で示される。

【0019】

[カプセルの調製]

1. カプセル1

カプセル1は、アルギン酸ナトリウム、アルギン酸プロピレングリコール、香料、水からなるもので、全成分をミキサーにてエマルジョンにし、水性塩化カルシウム溶液の中に滴下しカプセル化した。（粒子径：1.0mm、内包物：香料）

2. カプセル2

カプセル2は、カラギーナン、香料、水を含む全成分を加熱攪拌し、均一になったところで乳酸カルシウム水溶液に滴下しカプセル化した。（粒子径：0.5mm、内包物：香料）

3. カプセル3

カプセル 3 は、ゼラチン、アラビアガム、水を含む全成分を加熱溶解し、香料を加えミキサーにてエマルジョンにし、塩化カルシウム溶液に滴下し、カプセル化した。（粒子径：1.0 mm、内包物：香料）

4. カプセル 4

カプセル 4 は、アルギン酸ナトリウム、寒天、トリクロサン、水からなるもので、全成分をミキサーにてエマルジョンにし、水性塩化カルシウム溶液の中に滴下しカプセル化した。（粒子径：3.0 mm、内包物：トリクロサン）

5. カプセル 5

カプセル 5 は、アルギン酸ナトリウム、ジェランガム、丁字油、水を含む全成分を加熱攪拌し、均一になったところで乳酸カルシウム水溶液に滴下しカプセル化した。（粒子径：2.0 mm、内包物：丁子油）

【0020】

次に表 1 に示すカプセル配合歯磨を製造し、歯磨中の崩壊強度、内包物の放出感及び使用後の口腔内のカプセル残存感を評価した。評価方法及び結果を示す。

〔評価方法〕

1. 歯磨中のカプセル崩壊強度

夫々の歯磨からカプセルを分離、洗浄して測定サンプルとする。崩壊強度はレオロジー測定装置（サン科学社製：サンレオメーター C R - 2 0 0 D）を用いて測定した。本発明のカプセル崩壊強度とは、カプセルが崩壊した時の荷重で示される。

【0021】

2. 内包物の放出感

パネラー 10 名が、実施例 1～2、比較例 1～2 を夫々歯ブラシに 1 g とり、それを用いてブラッシングし、内包物の放出実感を次の評価基準により評価し、その平均値で示した。

評価基準

- 5：粒が割れて、味の変化がはっきりと感知できた
- 4：味の変化は感知できた
- 3：よくわからなかった
- 2：味が変化しなかった
- 1：粒がわれなかった

【0022】

3. カプセル残存感

パネラー 10 名が、実施例 1～2、比較例 1～2 を夫々歯ブラシに 1 g とり、それを用いてブラッシングし、吐出後の口腔内へのカプセル残存感を次の評価基準により評価し、その平均値で示した。

評価基準

- 5：残存感は全くなかった
- 4：残存感はほとんどなかった
- 3：残存感はわからなかった
- 2：残存感がややあった
- 1：残存感があった

【0023】

内包物の放出実感及び吐出後の口腔内へのカプセル残存感についての評価結果を表 1 に示す。

【0024】

【表1】

配合成分(%)	実施例1	実施例2	比較例1	比較例2
無水ケイ酸	19	19	19	19
カルボキシメチルセルロースナトリウム	0.8	0.8	0.8	0.8
硫酸マグネシウム	2	2	2	2
モノフルオロリン酸ナトリウム	0.7	0.7	0.7	0.7
ソルビトール	59	59	59	59
ポリエチレングリコール	4	4	4	4
サッカリンナトリウム	0.2	0.2	0.2	0.2
無水リン酸ナトリウム	0.15	0.15	0.15	0.15
ラウリル硫酸ナトリウム	2	2	2	2
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油	1	1	1	1
香料	0.5	0.5	0.5	0.5
カプセル1	2.5	—	—	2.5
カプセル2	—	1.0	—	—
カプセル3	—	—	2.5	—
水	残部	残部	残部	残部
合計	100	100	100	100
製剤中の崩壊強度(N)	0.01	0.02	1.5	0.9
香料放出実験	4.8	4.2	1.3	3.4
カプセル残存感	4.6	4.0	2.1	1.6

表1

【0025】

以下、実施例3～6を常法によって製造した。

実施例3 練菌磨

成分

	配合量 (%)
無水ケイ酸	10.0
キサンタンガム	0.7
硫酸マグネシウム	2.0
モノフルオロリン酸ナトリウム	0.7
ソルビトール	59.0
ポリエチレングリコール	4.0
サッカリンナトリウム	0.2
ラウリル硫酸ナトリウム	1.0
香料	0.5
カプセル4	1.0
水	残部
合計	100.0

【0026】

実施例 4 練歯磨

成分	配合量 (%)
無水ケイ酸	15.0
カルボキシメチルセルロースナトリウム	1.0
ソルビトール	40.0
濃グリセリン	7.0
プロピレングリコール	1.0
サッカリンナトリウム	0.1
N-ラウロイルザルコシネート	0.5
アルキルグルコシド	2.0
香料	0.7
カプセル 5	3.0
水	残部
合計	100.0

【0027】

実施例 5 液状歯磨

成分	配合量 (%)
モノフルオロリン酸ナトリウム	0.7
ソルビトール	54.0
濃グリセリン	2.0
エタノール	5.0
硫酸マグネシウム	2.0
サッカリンサンナトリウム	0.2
カラギーナン	0.5
ラウリル硫酸ナトリウム	0.5
ポリグリセリン脂肪酸エステル	2.0
香料	0.9
カプセル 1	2.0
水	残部
合計	100.0

【0028】

実施例 6 洗口液

成分	配合量 (%)
トリクロサン	0.02
濃グリセリン	15.0
エタノール	7.0
硫酸マグネシウム	2.0
サッカリンナトリウム	0.2
ラウリルスルホコハク酸ナトリウム	0.5
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油	2.0
香料	0.5
カプセル 2	1.5
水	残部
合計	100.0

【書類名】 要約書

【要約】

【課題】 口腔用組成物の使用時に容易にカプセル粒が崩壊し、速やかに内包物が放出・分散されるとともに、口中にカプセル皮膜残渣が残らない口腔用組成物を提供することを目的とする。

【解決手段】 アルギン酸塩、キサンタンガム、寒天、カラギーナン、ジェランガム、グルコマンナン、ローカストビンガムから選ばれる成分で、組成物中における崩壊強度が 0 . 0 5 N 以下である油性成分を内包したカプセルを製造し、これを口腔用組成物に配合すると、使用時に容易にカプセル粒が崩壊し、速やかにそれに内包された油性成分が放出・分散され、且つすすぎ時に口中にカプセル成分が異物として残らないカプセル配合口腔用組成物が提供できる。

【選択図】 なし

特願 2 0 0 3 - 4 3 6 4 3 4

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号

[0 0 0 1 0 6 3 2 4]

1. 変更年月日

1 9 9 0 年 8 月 2 3 日

[変更理由]

新規登録

住 所

大阪府高槻市朝日町 3 番 1 号

氏 名

サンスター株式会社